



(12) Translation of
European patent specification

(11) NO/EP 2280928 B1

NORWAY

(19) NO
(51) Int Cl.
C07C 205/50 (2006.01)
A61K 31/201 (2006.01)
A61P 7/00 (2006.01)
A61P 9/00 (2006.01)
A61P 13/00 (2006.01)
A61P 15/00 (2006.01)
A61P 17/00 (2006.01)
A61P 19/00 (2006.01)
A61P 25/00 (2006.01)

Norwegian Industrial Property Office

(21) Translation Published 2019.01.07

(80) Date of The European Patent Office Publication of the Granted Patent 2018.07.25

(86) European Application Nr. 09739186.6

(86) European Filing Date 2009.04.30

(87) The European Application's Publication Date 2011.02.09

(30) Priority 2008.05.01, US, 49649

(84) Designated Contracting States: AT ; BE ; BG ; CH ; CY ; CZ ; DE ; DK ; EE ; ES ; FI ; FR ; GB ; GR ; HR ; HU ; IE ; IS ; IT ; LI ; LT ; LU ; LV ; MC ; MK ; MT ; NL ; NO ; PL ; PT ; RO ; SE ; SI ; SK ; TR

(73) Proprietor Complexa Inc., 1055 Westlakes Drive, Suite 200,, Berwyn, PA 19312, USA
University of Pittsburgh - Of the Commonwealth System of Higher Education, 1st Floor Gardner Steel Conference Center 130 Thackeray Avenue, Pittsburgh, PA 15260, USA

(72) Inventor FREEMAN, Bruce, A., 5801 Wilkins Avenue, PittsburghPA 15218, USA
BRANCHAUD, Bruce, 3873 Monroe Street, EugeneOR 94705, USA

(74) Agent or Attorney HÅMSØ PATENTBYRÅ AS, Postboks 171, 4301 SANDNES, Norge

(54) Title **VINYL SUBSTITUTED FATTY ACIDS**

(56) References Cited: WO-A1-01/78719, WO-A1-01/79156, MA, SHENGMING ET AL: "Hydrohalogenation reaction of substituted 1,2-allenic carboxylic acids, esters, amides, nitriles, and diphenyl phosphine oxides" SYNTHESIS, vol. 5, 2001, pages 713-730, XP002544315 ISSN: 0039-7881, WO-A2-02/22559, GORCZYNSKI, M. J. ET AL: "Regio- and Stereospecific Synthesis and Nitric Oxide Donor Properties of (E)-9- and (E)-10-Nitrooctadec-9-enoic Acids" ORGANIC LETTERS, vol. 8, no. 11, 2006, pages 2305-2308, XP002544089, WO-A2-01/78654

Enclosed is a translation of the patent claims in Norwegian. Please note that as per the Norwegian Patents Acts, section 66i the patent will receive protection in Norway only as far as there is agreement between the translation and the language of the application/patent granted at the EPO. In matters concerning the validity of the patent, language of the application/patent granted at the EPO will be used as the basis for the decision. The patent documents published by the EPO are available through Espacenet (<http://worldwide.espacenet.com>) or via the search engine on our website here: <https://search.patentstyret.no/>

P a t e n t k r a v

1. Forbindelse omfattende en umettet eller flerumettet fettsyre som har en alifatisk kjede omfattende et oddetall karboner og én eller flere elektrontrekkende grupper valgt fra gruppen bestående av aldehyd (-COH), acyl (-COR), karbonyl (-CO),
5 karboksylsyre (-COOH), ester (-COOR), 1°, 2° og 3° ammonium (-NR₃⁺) og nitro (-NO₂), hvor R er et hydrogen, metyl eller C₂-C₆ alkyl, og hvor minst én elektrontrekkende gruppe er posisjonert på et alfa-, beta- eller gammakarbon i minst én karbon-karbon-dobbeltbinding i den umettede eller flerumettede fettsyren, eller et farmasøytisk akseptabelt salt derav.
- 10 2. Forbindelse ifølge krav 1, hvor den alifatiske kjeden har 5, 7, 9, 11, 13, 15, 17, 19, 21 eller 23 karboner.
3. Forbindelse ifølge krav 1, hvor minst én av den ene eller de flere elektrontrekkende gruppene er en elektrontrekkende vinylgruppe eller en elektrontrekkende allylgruppe.
- 15 4. Forbindelse ifølge krav 1, hvor karbon-karbon-dobbeltbindingen som har én eller flere elektrontrekkende grupper posisjonert på et alfa-, beta- eller gammakarbon i karbon-karbon-dobbeltbindingen er i cis-konfigurasjon og opptrer ved hvilket som helst karbon i den alifatiske kjeden av den umettede eller flerumettede fettsyren.
5. Forbindelse ifølge krav 1, hvor karbon-karbon-dobbeltbindingen som har én
20 eller flere elektrontrekkende grupper posisjonert på et alfa-, beta- eller gammakarbon i karbon-karbon-dobbeltbindingen er i trans-konfigurasjon og opptrer ved hvilket som helst karbon i den alifatiske kjeden av den umettede eller flerumettede fettsyren.
6. Forbindelse ifølge krav 1, hvor den ene eller de flere elektrontrekkende gruppene er i en absolutt stereokjemi av R eller S ved et sp³ kiralt/stereogenisk senter.
- 25 7. Forbindelse ifølge krav 1, hvor den umettede eller flerumettede fettsyren er en fettsyre med to eller flere konjugerte karbon-karbon-dobbeltbindinger, hvor minst én av den ene eller de flere elektrontrekkende gruppene er posisjonert på et karbon i de to eller flere konjugerte karbon-karbon-dobbeltbindingene.
8. Forbindelse ifølge krav 1, hvor minst én av den ene eller de flere
30 elektrontrekkende gruppene er posisjonert ved C-9, C-10, C-12, C-13 eller en kombinasjon derav.

9. Forbindelse ifølge krav 1, videre omfattende én eller flere andre funksjonelle grupper enn en elektrontrekkende gruppe som er posisjonert ved hvilket som helst karbon i den umettede eller flerumettede fettsyren.

5 10. Blanding omfattende forbindelsen ifølge krav 1, og videre omfattende en farmasøytisk akseptabel bærer eller eksipiens som omfatter ett eller flere av fortynningsmidler, fyllstoffer, desintegranter, bindemidler, smøremidler, overflateaktive stoffer, hydrofobe vehikler, vannløselige vehikler, emulgatorer, buffere, fuktmidler, fuktighetsbevarere, løselighetsformidlere, antioksidanter, konserveringsmidler eller kombinasjoner derav.

10 11. Blanding ifølge krav 10, hvor blandingen er formulert som et faststoff, løsning, pulver, fluidemulsjon, fluidsuspensjon, halvfast eller tørt pulver.

12. Forbindelse ifølge hvilket som helst av kravene 1 til 9, for anvendelse i terapi.

15 13. Forbindelse ifølge krav 12, for anvendelse i terapi med det vilkår at den elektrontrekkende gruppen ikke er nitro (-NO₂).

14. Forbindelse ifølge krav 12 eller 13, for anvendelse i behandlingen av en tilstand valgt fra gruppen bestående av arteriell stenose, forbrenninger, hypertensjon, fedme, nevrodegenerative sykdommer, hudlidelser, artritt, autoimmun sykdom, autoinflammatorisk sykdom, lupus, Lymes sykdom, gikt, sepsis, hypertermi, ulcus, 20 enterokolitt, osteoporose, virale eller bakterielle infeksjoner, cytomegalovirus, periodontal sykdom, glomerulonefritt, sarkoidose, lungesykdom, kronisk lungeskade, åndenød, lungebetennelse, lungefibrose, astma, akkvirert åndenødsyndrom, tobakksforårsaket lungesykdom, granulomdannelse, leverfibrose, sykdom hos mottaker av transplantat, postoperativ betennelse, koronar og perifer kar-restenose etter 25 angioplastikk, stentplassering eller bypass-transplantasjon, akutt og kronisk leukemi, B-lymfocyt leukemi, neoplastiske sykdommer, arteriosklerose, aterosklerose, hjertemuskelbetennelse, psoriasis, immunsvikt, disseminert intravaskulær koagulasjon, systemisk sklerose, amyotrofisk lateralsklerose, multippel sklerose, Parkinsons sykdom, Alzheimers sykdom, encefalomyelitt, ødem, inflammatorisk tarmsykdom, hyper IgE- 30 syndrom, kreftmetastase eller -vekst, adoptiv immunterapi, reperfusjonssyndrom, strålingsforbrenninger, alopeci, betennelsessykdom, diabetes og stoffskiftesyndrom.